

(12) NACH DEM VERTRÄG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/073213 A2

(31) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 317/44,
491/08, 209/52

CH-3900 Brig (CH). BRIEDEN, Walter [DE/CH];
Bleika, CH-3938 Ausserberg (CH).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/000643

(74) Gemeinsamer Vertreter: LONZA AG; Münchensteinerstrasse 38, CH-4052 Basel (CH).

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. Januar 2005 (24.01.2005)

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsan): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

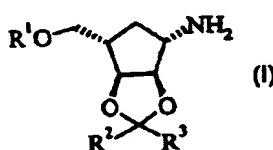
(30) Angaben zur Priorität:
04002055.4 30. Januar 2004 (30.01.2004) EP

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsan): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Titel: METHOD FOR THE PRODUCTION OF 3-AMINO-5-(HYDROXYMETHYL)CYCLOPENTANE-1,2-DIOL DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 3-AMINO-5-(HYDROXYMETHYL)CYCLOPENTAN-1,2-DIOLDERIVATEN



WO 2005/073213 A2

(57) **Abstract:** The invention relates to a method for the production of acetals and ketals of 3-amino-5-(hydroxymethyl)cyclopentane-1,2-diols of formula (I) (and/or the enantiomer), where R¹ = H, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₈ cycloalkyl or benzyl and i) R² = methyl and R³ = ethyl, ii) R² = H and R³ = C₁₋₄ alkyl or phenyl or iii) R² and R³ together form a group of formula -(CH₂)_n- with n = 4 to 6, present as free amines or as salts of di- or tri-basic organic acids, starting from 2-acetyl-2-aza-bicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one of formula (II) (and/or the enantiomer). The method is equally useful, depending on the starting material, for the production of enantiomerically-pure compounds, or mixtures with arbitrary enantiomeric content.

(57) **Zusammenfassung:** Gegenstand der Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von Acetalen und Ketalen von 3-Amino-5-(hydroxymethyl)cyclopentan-1,2-diolen der Formel (I) und/oder Spiegelbild worin R¹ Wasserstoff, C₁₋₄-Alkyl, C₁₋₈-Cycloalkyl oder Benzyl ist und worin i) R² Methyl und R³ Ethyl, ii) R² Wasserstoff und R³ C₁₋₄-Alkyl oder Phenyl oder iii) R² und R³ zusammen eine Gruppe der Formel -(CH₂)_n- mit n = 4 bis 6 bedeuten, und die als freie Amine oder als Salze zwei- oder dreibasierer organischer Säuren vorliegen, ausgehend von 2-Acetyl-2-aza-bicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on der Formel (II) und/oder Spiegelbild Das Verfahren ist, abhängig von der Zusammensetzung des Eduktes, gleichermaßen geeignet zur Herstellung enantiomerereiniger Verbindungen oder von Gemischen beliebiger Enantiomerenzusammensetzung.